

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

BLACK BORDERS

- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

(19) BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

(12) Offenlegungsschrift
(11) DE 3825041 A1

(21) Aktenzeichen: P 38 25 041.1
(22) Anmeldetag: 20. 7. 88
(43) Offenlegungstag: 15. 2. 90

Behördeneigentum

(51) Int. Cl. 5:

C 07 D 471/14

A 01 N 43/90

A 01 N 47/24

A 01 N 47/34

// (C07D 471/14,

221:00,239:00,249:00,

213:02,

333:04)C07D 249/14,

401/12,409/12

DE 3825041 A1

(71) Anmelder:

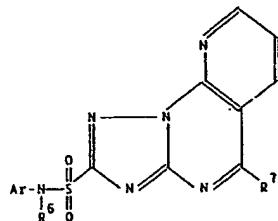
Schering AG, Berlin und Bergkamen, 1000 Berlin, DE

(72) Erfinder:

Wegner, Peter, Dipl.-Chem. Dr.; Krüger, Martin,
Dipl.-Chem. Dr.; Krüger, Gabriele, Dipl.-Chem. Dr.,
1000 Berlin, DE; Head, John, Dr., Bishop's Stortford,
Hertfordshire, GB; Rees, Richard, Dipl.-Biol. Dr.;
Johann, Gerhard, Dipl.-Agr.-Ing. Dr., 1000 Berlin, DE

(54) Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin- 2-sulfonsäureamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre
Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung

Die Erfindung betrifft neue Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen
Formel I



(I)

in der Ar, R⁶ und R⁷ die in der Beschreibung genannten Be-
deutungen haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre
Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstums-
regulierender und fungizider Wirkung.

DE 3825041 A1

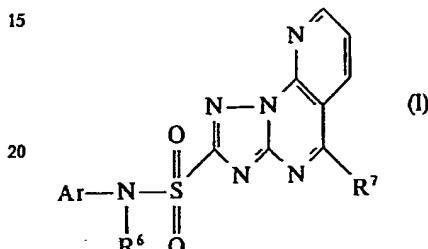
Beschreibung

Die Erfindung betrifft neue Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung.

Es ist bereits bekannt, daß Triazolsulfonamide eine herbizide Wirkung besitzen (EP-Anmeldungen 01 42 152, 01 50 974 und 02 46 749). Häufig ist jedoch die Herbizidwirkung der bekannten Verbindungen nicht ausreichend, beziehungsweise es treten bei entsprechender Herbizidwirkung Selektivitätsprobleme in landwirtschaftlichen Hauptkulturen auf.

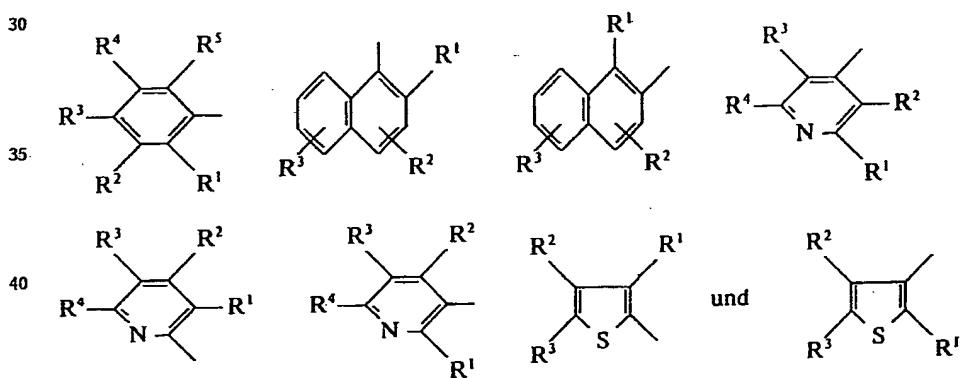
Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist die Bereitstellung von neuen Verbindungen, die diese Nachteile nicht aufweisen und in ihren biologischen Eigenschaften den bisher bekannten Verbindungen überlegen sind.

Es wurde nun gefunden, daß Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I



25

Ar eine Phenyl-, Naphthyl-, Pyridyl- oder Thienylgruppe der allgemeinen Formeln



45 R¹, R², R³, R⁴ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, einen C₁–C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁–C₄-alkyl, C₁–C₄-Alkoxy, Halogen-C₁–C₄-alkoxy, C₁–C₄-Alkylthio, C₁–C₄-Alkylsulfinyl oder C₁–C₄-Alkylsulfonyl substituierten
 50 C₁–C₆-Alkylrest, einen C₂–C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁–C₄-alkyl, C₁–C₄-Alkoxy, Halogen-C₁–C₄-alkoxy, C₁–C₄-Alkylthio, C₁–C₄-Alkylsulfinyl oder C₁–C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂–C₆-Alkenylrest, einen C₂–C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁–C₄-alkyl, C₁–C₄-Alkoxy, Halogen-C₁–C₄-alkoxy, C₁–C₄-Alkylthio, C₁–C₄-Alkylsulfinyl oder C₁–C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂–C₆-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine C₁–C₄-Alkoxygruppe, eine Halogen-C₁–C₄-alkoxygruppe, eine Gruppe R⁸–O–CO–, eine Aminocarbonylgruppe R⁹R¹⁰N–CO–, eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N–, eine Cyanogruppe, eine Nitrogruppe, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸–S(O)_n–, eine Acylgruppe R⁸–CO–, eine Gruppe R⁸–O–CO–(CH₂)_n–, einen Phenylrest, einen durch C₁–C₄-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen Phenoxyrest oder einen durch C₁–C₄-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenoxyrest,
 55 R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Acylgruppe R⁸–CO–, eine Gruppe R⁸–O–CO–, einen C₁–C₆-Alkylrest, einen C₂–C₆-Alkenylrest, einen C₂–C₆-Alkinylrest, einen Phenyl-C₁–C₄-alkylrest, eine Aminocarbonylgruppe R⁹R¹⁰N–CO–, ein Alkalimetallatom, ein einwertiges Metalläquivalent aus der Gruppe der Erdalkalimetalle und weiterer Metalle, einen Ammoniumrest oder einen durch C₁–C₆-Alkyl substituierten Ammoniumrest, R⁷ ein Wasserstoffatom, einen C₁–C₆-Alkylrest, einen durch Halogen und/oder C₁–C₄-Alkoxy substituierten C₁–C₆-Alkylrest, einen C₂–C₆-Alkenylrest, einen durch Halogen und/oder C₁–C₄-Alkoxy substituierten C₂–C₆-Alkenylrest, einen C₂–C₆-Alkinylrest, einen durch Halogen und/oder C₁–C₄-Alkoxy substituierten C₂–C₆-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine Hydroxygruppe, einen C₁–C₆-Alkoxyrest, einen Halogen-C₁–C₆-alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸–S(O)_n– oder eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N–, R⁸ ein Wasserstoffatom, einen C₁–C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, einen Phenyl-C₁—C₄-alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten Phenyl-C₁—C₄-alkylrest, einen Phenylrest oder einen durch Halogen, Nitro oder C₁—C₄-Alkyl substituierten Phenylrest, R⁹ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, R¹⁰ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, oder R⁹ und R¹⁰ gemeinsam mit dem benachbarten Stickstoffatom eine Pyrolidinylgruppe, eine Piperidinogruppe oder eine Morphinogruppe und n 0, 1 oder 2

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

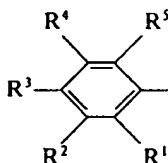
65

bedeuten, eine interessante herbizide, pflanzenwachstumsregulierende und fungizide Wirkung zeigen.

Der Begriff "Halogen" im Zusammenhang mit Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Phenyl bedeutet, daß ein oder mehrere Wasserstoffatome durch ein oder mehrere Halogenatome ersetzt sind. Die Bezeichnung "Halogen" umfaßt Fluor, Chlor, Brom und Jod.

Als besonders wirksam haben sich solche Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I erwiesen, bei denen

Ar eine Phenylgruppe der allgemeinen Formel



R¹ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Halogenatom, einen Methylrest, einen Trifluormethylrest, eine Nitrogruppe, einen Methoxyrest oder eine Methoxycarbonylgruppe, R², R³ und R⁴, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, ein Halogenatom, einen Trifluormethylrest oder einen C₁—C₄-Alkylrest,

R⁶ ein Wasserstoffatom, ein einwertiges Metalläquivalent oder eine C₁—C₄-Acylgruppe und

R⁷ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₄-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest oder einen C₁—C₄-Alkoxyrest

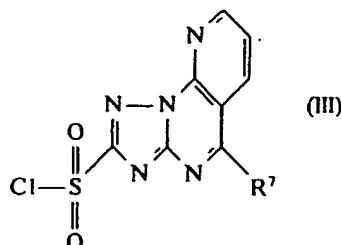
bedeuten.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I können zum Beispiel hergestellt werden, indem man

A) Amine der allgemeinen Formel II

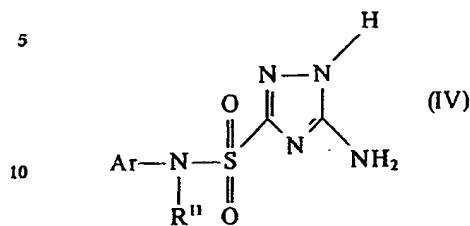


in der Ar die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat und R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest oder einen C₂—C₆-Alkinylrest bedeutet, mit einem Sulfonsäurechlorid der allgemeinen Formel III

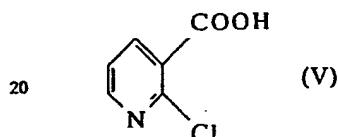


in der R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel

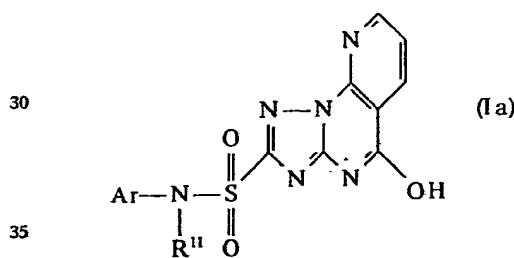
in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,
B) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV



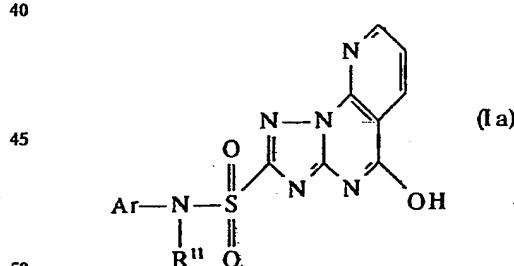
15 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit 2-Chlornicotinsäure der Formel V



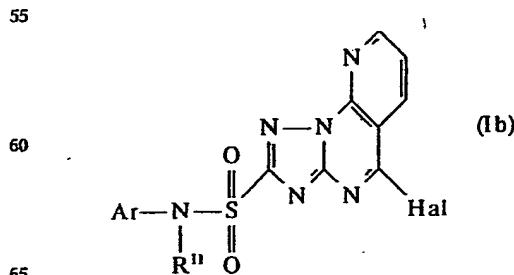
25 in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und weiterer Katalysatoren zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ia



40 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt,
C) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia

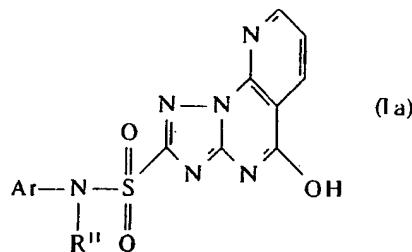


55 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Halogenierungsreagenz in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

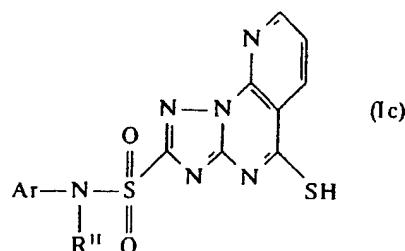


70 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, umgesetzt,

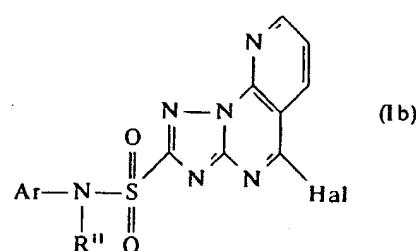
D) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia



in der Ar und R'' die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit Lawesson's Reagenz oder Phosphorpentasulfid in einem geeigneten Lösungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ic



in der Ar und R'' die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,
E) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ib



in der Ar und R'' die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, mit einem Alkohol der allgemeinen Formel VI

$\text{HO}-\text{R}^{12}$ (VI)

45

in der R^{12} einen C_1-C_6 -Alkylrest oder einen Halogen- C_1-C_6 -alkylrest bedeutet, mit einer Schwefel enthaltenden Verbindung der allgemeinen Formel VII

$\text{HS(O)}_n-\text{R}^8$ (VII)

50

in der R^8 und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, oder einem Amin der allgemeinen Formel VIII

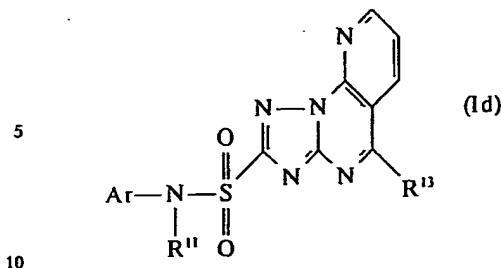
$\text{H}-\text{NR}^9\text{R}^{10}$ (VIII)

55

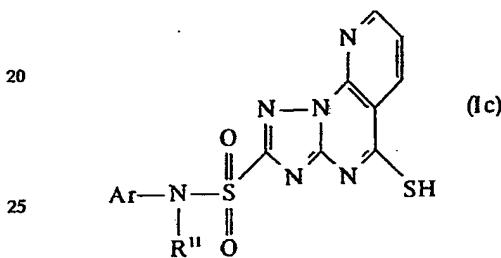
in der R^9 und R^{10} die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, in einem geeigneten Lösungsmittel und in Gegenwart eines Säureakzeptors oder Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Id

60

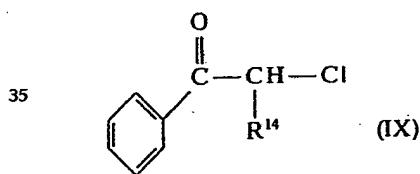
65



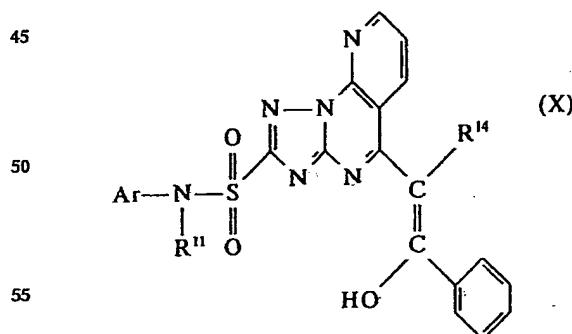
in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und R¹³ einen C₁—C₆-Alkoxyrest, einen Halogen-C₁—C₆-alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸—S(O)_n— oder eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N— bedeutet, wobei R⁸, R⁹, R¹⁰ und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,
15 F) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ic



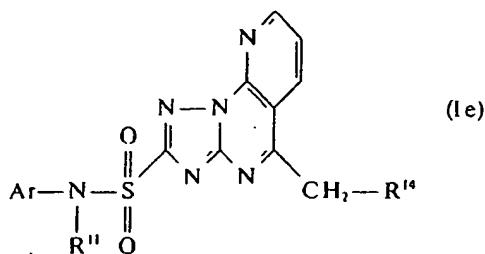
in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einer
30 Verbindung der allgemeinen Formel IX



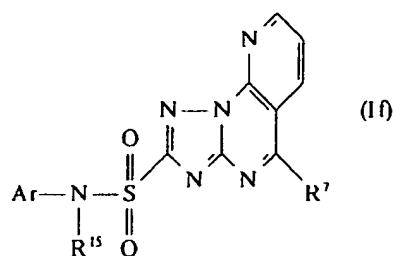
40 in der R¹⁴ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₅-Alkylrest, einen C₂—C₅-Alkenylrest oder einen C₂—C₅-Alkynylrest bedeutet, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls eines Katalysators zunächst zu Verbindungen der allgemeinen Formel X



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II und R¹⁴ die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, und anschließend durch Erhitzen in einem geeigneten Lösungsmittel in
60 Gegenwart einer Base in einer Retro-Aldol-Reaktion zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ie



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II und R¹⁴ die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,
G) eine Verbindung der allgemeinen Formel If



in der Ar und R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R¹⁵ ein Wasserstoffatom oder ein einwertiges Metalläquivalent bedeutet, mit Verbindungen der allgemeinen Formel XII

R⁸-Hal (XII)

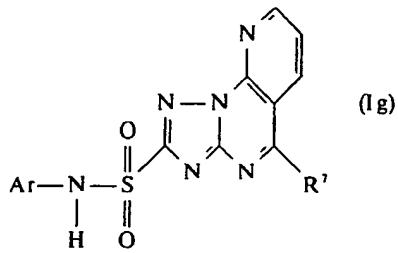
oder der allgemeinen Formel XIII

R⁸-CO-Hal (XIII)

in denen R⁸ die unter der allgemeinen Formel I genannte Bedeutung hat, aber nicht für ein Wasserstoffatom steht, und Hal Chlor oder Brom bedeutet, oder der allgemeinen Formel XIV

R⁸-CO-O-CO-R⁸ (XIV)

in der R⁸ die oben genannte Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel umsetzt,
H) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ig



in der Ar und R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel XV

M-Y (XV)

in der M ein einwertiges Metalläquivalent und Y ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Niederalkyl-, Niederalkoxy- oder Aminogruppe bedeutet, in einem Lösungsmittel umsetzt.

Die einzelnen Verfahrensvarianten werden vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Zu diesem Zweck können sämtliche gegenüber den verwendeten Reagenzien inerte Lösungsmittel verwendet werden.

Beispiele für solche Lösungsmittel beziehungsweise Verdünnungsmittel sind Wasser, aliphatische, alicyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, die jeweils gegebenenfalls chloriert sein können, wie zum Beispiel Hexan,

Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylol, Methylenchlorid, Chloroform, Kohlenstofftetrachlorid, Ethylenchlorid und Trichlorethylen, Ether, wie zum Beispiel Diisopropylether, Dibutylether, Propylenoxid, Dioxan und Tetrahydrofuran, Ketone, wie zum Beispiel Aceton, Methylthylketon, Methylisopropylketon und Methylisobutylketon, Nitrile, wie zum Beispiel Acetonitril und Propionitril, Alkohole, wie zum Beispiel Methanol, Ethanol, Isopropanol, Butanol und Ethylenglycol, Ester, wie zum Beispiel Ethylacetat und Amylacetat, Säureamide, wie zum Beispiel Dimethylformamid und Dimethylacetamid, Sulfone und Sulfoxide, wie zum Beispiel Dimethylsulfoxid und Sulfolan, und Basen, wie zum Beispiel Pyridin.

Die Reaktionen werden vorzugsweise zwischen Raumtemperatur und dem Siedepunkt des jeweiligen Reaktionsgemisches durchgeführt. Die Reaktionen lassen sich bei dem Druck der Umgebung durchführen, wenn gleich sie auch bei erhöhtem beziehungsweise verminderter Druck durchgeführt werden können.

Die Verfahrensvariante A) wird vorzugsweise in chlorierten Kohlenwasserstoffen, wie Dichlormethan oder Dichlorethan, in Anwesenheit eines Katalysators beziehungsweise Säureakzeptors durchgeführt. Beispiele hierfür sind tertiäre Amine, wie zum Beispiel Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, 4-Dimethylaminopyridin und Pyridin. Pyridin kann sowohl als Katalysator als auch als Lösungsmittel bei dieser Reaktion verwendet werden.

Die Verfahrensvarianten B) bis F) werden bevorzugt in Gegenwart von Verdünnungsmitteln wie aliphatischen, alicyclischen und aromatischen Kohlenwasserstoffen, die jeweils gegebenenfalls chloriert sein können, wie zum Beispiel Hexan, Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylol, Methylenchlorid, Chloroform, Kohlenstofftetrachlorid, Ethylenchlorid und Trichlorethylen, Ethern, wie zum Beispiel Diisopropylether, Dibutylether, Propylenoxid, Dioxan und Tetrahydrofuran, Ketonen, wie zum Beispiel Aceton, Methylthylketon, Methylisopropylketon und Methylisobutylketon, Nitrilen, wie zum Beispiel Acetonitril und Propionitril, Estern, wie zum Beispiel Ethylacetat und Amylacetat, Säureamiden, wie zum Beispiel Dimethylformamid und Dimethylacetamid, Sulfoxiden und Sulfonen, wie zum Beispiel Dimethylsulfoxid und Sulfolan, und Basen, wie zum Beispiel Pyridin, und gegebenenfalls in Anwesenheit eines Katalysators beziehungsweise Säureakzeptors durchgeführt. Beispiele hierfür sind tertiäre Amine, wie zum Beispiel Triethylamin, Diisopropylethylamin, N-Methylmorpholin, 4-Dimethylaminopyridin oder Pyridin.

Die Verfahrensvariante G) wird vorzugsweise so durchgeführt, daß man eine Verbindung der allgemeinen Formel I in einem geeigneten Lösungsmittel mit Verbindungen der allgemeinen Formeln XII, XIII oder XIV umsetzt, die in der Regel schwer löslichen anorganischen Salze abfiltriert und die gewünschten Verbindungen nach Abdampfen der Lösungsmittel erhält.

Die Verfahrensvariante H) wird vorzugsweise so durchgeführt, daß man eine Verbindung der allgemeinen Formel I_g in einem geeigneten Lösungsmittel mit einer Metallbase, wie einem Metallhydroxid, Metallhydrid, Metallalkyl oder Metallamid, umsetzt und die in der Regel schwerer löslichen Salze abfiltriert oder nach Abdampfen der Lösungsmittel erhält.

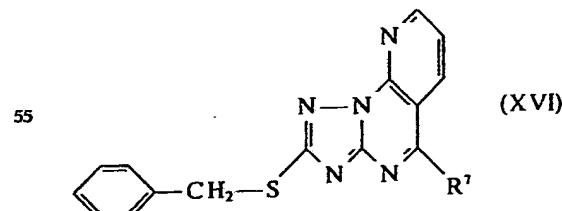
Die nach den oben genannten Verfahren hergestellten erfundungsgemäßen Verbindungen können nach den üblichen Verfahren aus dem Reaktionsgemisch isoliert werden, beispielsweise durch Abdestillieren des eingesetzten Lösungsmittels bei normalem oder verminderter Druck, durch Ausfällen mit Wasser oder durch Extraktion.

Ein erhöhter Reinheitsgrad kann in der Regel durch säulenchromatographische Aufreinigung sowie durch fraktionierte Destillation oder Kristallisation erhalten werden.

Die erfundungsgemäßen Verbindungen stellen in der Regel farb- und geruchlose Kristalle dar, die wenig löslich in Wasser und in aliphatischen Kohlenwasserstoffen, wie Petrolether, Hexan, Pentan und Cyclohexan, gut löslich in halogenierten Kohlenwasserstoffen, wie Chloroform, Methylenchlorid und Tetrachlorkohlenstoff, aromatischen Kohlenwasserstoffen, wie Benzol, Toluol und Xylol, Ethern, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, Carbonsäurenitrilen, wie Acetonitril, Alkoholen, wie Methanol und Ethanol, Carbonsäureamiden, wie Dimethylformamid, und Sulfoxiden, wie Dimethylsulfoxid, sind.

Die Sulfonsäurechloride der allgemeinen Formel III sind neu und lassen sich aus in der Literatur beschriebenen beziehungsweise nach bekannten Verfahren darstellbaren 2-Benzylthio-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidinen der allgemeinen Formel XVI

50



55

in der R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, durch Umsetzung mit Chlor in Wasser oder Wasser/Essigsäuregemischen herstellen.

Amine der allgemeinen Formel II sind zum Teil käuflich oder nach bekannten beziehungsweise in der Literatur beschriebenen Verfahren darstellbar.

60 Die erfundungsgemäßen Verbindungen zeigen eine gute herbizide Wirkung bei breitblättrigen Unkräutern und Gräsern. Ein selektiver Einsatz der erfundungsgemäßen Wirkstoffe ist in verschiedenen Kulturen möglich, zum Beispiel in Raps, Rüben, Sojabohnen, Baumwolle, Reis, Gerste, Weizen und anderen Getreidearten. Dabei sind einzelne Wirkstoffe als Selektivherbizide in Rüben, Baumwolle, Soja und Getreide besonders geeignet.

Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, wie zum Beispiel Forst-, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfundungsgemäßen Verbindungen können zum Beispiel bei den folgenden Pflanzengattungen verwendet werden:

5

Dikotyle Unkräuter der Gattungen Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Brassica, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Lamium, Veronica, Abutilon, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea und Chrysanthemum.

10

Monokotyle Unkräuter der Gattungen Avena, Alopecurus, Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Poa, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Cyperus, Agropyron, Sagittaria, Monochoria, Fimbristylis, Eleocharis, Ischaemum und Apera.

15

Die Aufwandmengen schwanken je nach Anwendungsart im Vor- und Nachauflauf in Grenzen zwischen 0,01 bis 5 kg/ha.

15

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe können auch als Defoliant, Desiccant und als Krautabtötungsmittel verwendet werden. Sie beeinflussen auch das Pflanzenwachstum und können deshalb zur Wachstumsbeeinflussung von Kulturpflanzen eingesetzt werden. Einige dieser Wirkstoffe zeigen auch eine fungizide Wirkung.

20

Die erfundungsgemäßen Verbindungen können entweder allein, in Mischung miteinander oder mit anderen Wirkstoffen angewendet werden. Gegebenenfalls können andere Pflanzenschutz- oder Schädlingsbekämpfungsmittel je nach dem gewünschten Zweck zugesetzt werden. Sofern eine Verbreiterung des Wirkungsspektrums beabsichtigt ist, können auch andere Herbizide zugesetzt werden. Beispielsweise eignen sich als herbizid wirksame Mischungspartner diejenigen Wirkstoffe, die in Weed Abstracts, Vol. 36, No. 12, 1987, unter dem Titel "List of common names and abbreviations employed for currently used herbicides and plant growth regulators in Weed Abstracts" aufgeführt sind.

25

Eine Förderung der Wirkintensität und der Wirkungsgeschwindigkeit kann zum Beispiel durch wirkungssteigernde Zusätze, wie organische Lösungsmittel, Netzmittel und Öle, erzielt werden. Solche Zusätze lassen daher gegebenenfalls eine Verringerung der Wirkstoffdosierung zu.

30

Zweckmäßig werden die gekennzeichneten Wirkstoffe oder deren Mischungen in Form von Zubereitungen, wie Pulvern, Streumitteln, Granulaten, Lösungen, Emulsionen oder Suspensionen, unter Zusatz von flüssigen und/oder festen Trägerstoffen beziehungsweise Verdünnungsmitteln und gegebenenfalls Haft-, Netz-, Emulgier- und/oder Dispergierhilfsmitteln angewandt.

35

Geeignete flüssige Trägerstoffe sind zum Beispiel aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylol, Cyclohexanon, Isophoron, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid, weiterhin Mineralölfraktionen und Pflanzenöle.

35

Als feste Trägerstoffe eignen sich Mineralien, zum Beispiel Bentonit, Silicagel, Talkum, Kaolin, Attapulgit, Kalkstein, und pflanzliche Produkte, zum Beispiel Mehle.

40

An oberflächenaktiven Stoffen sind zu nennen zum Beispiel Calciumligninsulfonat, Polyethylenalkylphenylether, Naphthalinsulfonsäuren und deren Salze, Phenolsulfonsäuren und deren Salze, Formaldehydkondensate, Fettalkoholsulfate sowie substituierte Benzolsulfonsäuren und deren Salze.

40

Der Anteil des beziehungsweise der Wirkstoffe(s) in den verschiedenen Zubereitungen kann in weiten Grenzen variieren. Beispielsweise enthalten die Mittel etwa 10 bis 90 Gewichtsprozent Wirkstoff, etwa 90 bis 10 Gewichtsprozent flüssige oder feste Trägerstoffe sowie gegebenenfalls bis zu 20 Gewichtsprozent oberflächenaktive Stoffe.

45

Die Ausbringung der Mittel kann in üblicher Weise erfolgen, zum Beispiel mit Wasser als Träger in Spritzbrühmengen etwa 100 bis 1000 Liter/ha. Eine Anwendung der Mittel im sogenannten Low-Volume und Ultra-Low-Volume-Verfahren ist ebenso möglich wie ihre Applikation in Form von sogenannten Mikrogranulaten.

45

Die Herstellung dieser Zubereitungen kann in an sich bekannter Art und Weise, zum Beispiel durch Mahl- oder Mischverfahren, durchgeführt werden. Gewünschtenfalls können Zubereitungen der Einzelkomponenten auch erst kurz vor ihrer Verwendung gemischt werden, wie es zum Beispiel im sogenannten Tankmixverfahren in der Praxis durchgeführt wird.

50

Zur Herstellung der verschiedenen Zubereitungen werden zum Beispiel die folgenden Bestandteile eingesetzt:

50

A) Spritzpulver

55

- | | |
|------------------------|---|
| 1.) 25 Gewichtsprozent | Wirkstoff |
| 60 Gewichtsprozent | Kaolin |
| 10 Gewichtsprozent | Kieselsäure |
| 5 Gewichtsprozent | einer Mischung aus dem Calciumsalz der Ligninsulfonsäure und dem Natriumsalz des N-Methyl-N-oleyl-taurins |

60

65

2) 40 Gewichtsprozent Wirkstoff
 25 Gewichtsprozent Tonmineralien
 25 Gewichtsprozent Kieselsäure
 10 Gewichtsprozent einer Mischung aus dem Calciumsalz der Ligninsulfosäure und
 5 Alkylphenylpolyglycolethern

B) Paste

10 45 Gewichtsprozent Wirkstoff
 5 Gewichtsprozent Natriumaluminiumsilikat
 15 Gewichtsprozent Cetylpolyglycoether mit 8 Mol Ethylenoxid
 2 Gewichtsprozent Spindelöl
 10 Gewichtsprozent Polyethylenglycol
 15 23 Gewichtsprozent Wasser

C) Emulsionskonzentrat

20 25 Gewichtsprozent Wirkstoff
 15 Gewichtsprozent Cyclohexanon
 55 Gewichtsprozent Xylool
 5 Gewichtsprozent einer Mischung aus dem Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfosäure und
 25 Nonylphenylpolyoxyethylen

Die nachstehenden Beispiele erläutern die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen:

Beispiel 1

30 5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfosäure-(2,6-dichloranilid)

15,79 g 5-Amino-1H-1,2,4-triazol-3-sulfosäure-(2,6-dichloranilid) in 24 ml Dimethylformamid werden mit
 8,08 g 2-Chlornicotinsäure, 12,98 g Kaliumcarbonat, 0,4 g Kupfer-Pulver und 0,2 g Kaliumjodid 5 Stunden unter
 35 Rühren auf 150°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird die Mischung in Wasser eingerührt und mit Salzsäure
 angesäuert. Das Produkt wird abgesaugt, mit Wasser und Ether gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet.

Ausbeute: 18,64 g = 89% der Theorie

Fp.: 337 – 340°C (Zers.)

Beispiel 2

5-Mercapto-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfosäure-(2,6-dichloranilid)

45 5,0 g 5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfosäure-(2,6-dichloranilid) werden in 60 ml
 Pyridin mit 3,69 g Phosphorpentasulfid 4 Stunden unter Rühren auf 100°C erhitzt. Nach dem Abkühlen wird das
 Produkt im Vakuum abdestilliert. Der Rückstand wird in 2N Natronlauge aufgenommen und zweimal mit
 Methylenchlorid extrahiert. Die wäßrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und mit Methylenchlorid extra-
 hiert. Das nach dem Einengen erhaltene Rohprodukt wird über Kieselgel chromatographiert.

50 Ausbeute: 4,27 g = 83% der Theorie
 Fp.: 282 – 285°C

Beispiel 3

55 5-Methoxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfosäure-(2,6-dichloranilid)

2,0 g 5-Chlor-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfosäure-(2,6-dichloranilid) werden in 55 ml Me-
 thanol mit 5,5 ml Triethylamin 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das überschüssige Methanol wird abdestilliert
 60 und der Rückstand mit 2N Salzsäure-Lösung verrührt. Das Produkt wird abgesaugt, mit Wasser, Ether und
 Petan gewaschen und im Vakuum getrocknet.

Ausbeute: 0,93 g = 47% der Theorie
 Fp.: 265 – 267°C

65 Analog zu den Beispielen 1 bis 3 lassen sich auch die folgenden erfindungsgemäßen Verbindungen herstellen.

Beispiel Nr.	Name der Verbindung	Physikalische Konstante
4	5-Methoxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2-chlor-6-fluoranilid)	Fp.: 261 – 264°C 5
5	5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2,6-dichlor-3-methylanilid)	
6	5-Hydroxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2-chlor-6-fluoranilid)	Fp.: 325 – 328°C 10
7	5-Methoxy-pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäure-(2,6-dichlor-3-methylanilid)	Fp.: 264 – 268°C

Die folgenden Beispiele erläutern die Anwendungsmöglichkeiten der erfundungsgemäßen Verbindungen. 15

Beispiel A

Im Gewächshaus wurden die aufgeführten Pflanzenspezies vor dem Auflaufen mit der aufgeführten Verbindung in einer Aufwandmenge von 0,3 kg Wirkstoff/ha behandelt. Die Verbindung wurde zu diesem Zweck als Emulsion oder Suspension mit 500 Litern Wasser/ha gleichmäßig über die Pflanzen versprüht. Hier zeigte drei Wochen nach der Behandlung die erfundungsgemäße Verbindung eine hohe Kulturpflanzenselektivität in Baumwolle bei ausgezeichneter Wirkung gegen das Unkraut. 20

In der folgenden Tabelle bedeuten:

- 0 = keine Schädigung
- 1 = 1 – 24% Schädigung
- 2 = 25 – 74% Schädigung
- 3 = 75 – 89% Schädigung
- 4 = 90 – 100% Schädigung 30

GOSHI = *Gossypium hirsutum*

ALOMY = *Alopecurus myosuroides*

MATCH = *Matricaria chamomilla*

SOLSS = *Solanum sp.*

35

VERPE = *Veronica persica*

VIOSS = *Viola sp.*

Erfundungsgemäße Verbindung	GOSHI	ALOMY	MATCH	SOLSS	VERPE	VIOSS	40
Beispiel 3	0	4	4	3	4	3	
Unbehandelt	0	0	0	0	0	0	45

Beispiel B

Im Gewächshaus wurden die aufgeführten Pflanzenspezies nach dem Auflaufen mit der aufgeführten Verbindung in einer Aufwandmenge von 0,1 kg Wirkstoff/ha behandelt. Die Verbindung wurde zu diesem Zweck als Emulsion oder Suspension mit 500 Litern Wasser/ha gleichmäßig über die Pflanzen versprüht. Hier zeigte zwei Wochen nach der Behandlung die erfundungsgemäße Verbindung eine hohe Kulturpflanzenselektivität in Mais bei ausgezeichneter Wirkung gegen das Unkraut. 50

In der folgenden Tabelle bedeuten:

- 0 = keine Schädigung
- 1 = 1 – 24% Schädigung
- 2 = 25 – 74% Schädigung
- 3 = 75 – 89% Schädigung
- 4 = 90 – 100% Schädigung 60

ZEAMX = *Zea mays*

IPOSS = *Ipomoea purpurea*

MATCH = *Matricaria chamomilla*

55

SOLSS = *Solanum sp.*

60

VERPE = *Veronica persica*

65

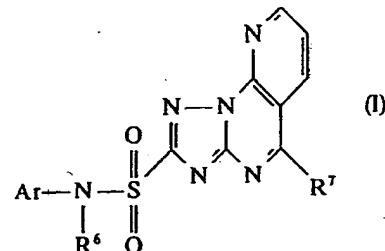
Erfindungsgemäße Verbindung	ZEAMX	IPOSS	MATCH	SOLSS	VERPE
5 Beispiel 3 Unbehandelt	1 0	3 0	4 0	4 0	4 0

Patentansprüche

10

1. Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide der allgemeinen Formel I

15

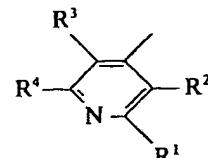
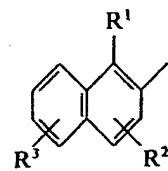
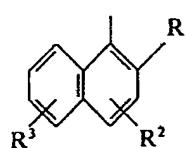
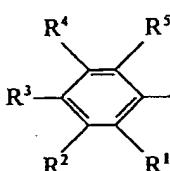


20

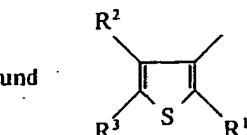
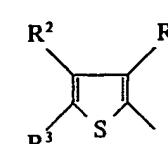
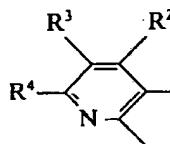
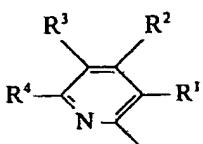
25

in der
Ar eine Phenyl-, Naphthyl-, Pyridyl- oder Thienylgruppe der allgemeinen Formeln

30



35



40

und

R¹, R², R³, R⁴ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁—C₄-alkyl, C₁—C₄-Alkoxy, Halogen-C₁—C₄-alkoxy, C₁—C₄-Alkylthio, C₁—C₄-Alkylsulfinyl oder C₁—C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁—C₄-alkyl, C₁—C₄-Alkoxy, Halogen-C₁—C₄-alkoxy, C₁—C₄-Alkylthio, C₁—C₄-Alkylsulfinyl oder C₁—C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, Halogen-C₁—C₄-alkyl, C₁—C₄-Alkoxy, Halogen-C₁—C₄-alkoxy, C₁—C₄-Alkylthio, C₁—C₄-Alkylsulfinyl oder C₁—C₄-Alkylsulfonyl substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine C₁—C₄-Alkoxygruppe, eine Halogen-C₁—C₄-alkoxygruppe, eine Gruppe R⁸—O—CO—, eine Aminocarbonylgruppe R⁹R¹⁰N—CO—, eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N—, eine Cyanogruppe, eine Nitrogruppe, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸—S(O)_n—, eine Acylgruppe R⁸—CO—, eine Gruppe R⁸—O—CO—(CH₂)_n—, einen Phenylrest, einen durch C₁—C₄-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenylrest, einen Phenoxyrest oder einen durch C₁—C₄-Alkyl, Halogen oder Nitro substituierten Phenoxyrest, R⁶ ein Wasserstoffatom, eine Acylgruppe R⁸—CO—, eine Gruppe R⁸—O—CO—, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen Phenyl-C₁—C₄-alkylrest, eine Aminocarbonylgruppe R⁹R¹⁰N—CO—, ein Alkalimetallatom, ein einwertiges Metalläquivalent aus der Gruppe der Erdalkalimetalle und weiterer Metalle, einen Ammoniumrest oder einen durch C₁—C₆-Alkyl substituierten Ammoniumrest, R⁷ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen durch Halogen und/oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen durch Halogen und/oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen durch Halogen und/oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, ein Halogenatom, eine Hydroxygruppe, einen C₁—C₆-Alkoxyrest, einen Halogen-C₁—C₆-alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸—S(O)_n— oder eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N—, R⁸ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen

ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, einen Phenyl-C₁—C₄-alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten Phenyl-C₁—C₄-alkylrest, einen Phenylrest oder einen durch Halogen, Nitro oder C₁—C₄-Alkyl substituierten Phenylrest,

5

R⁹ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest,

10

R¹⁰ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkenylrest, einen C₂—C₆-Alkinylrest, einen ein- oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy oder C₁—C₄-Alkoxy substituierten C₂—C₆-Alkinylrest, oder

15

R⁹ und R¹⁰ gemeinsam mit dem benachbarten Stickstoffatom eine Pyrrolidinylgruppe, eine Piperidinogruppe oder eine Morphinogruppe und

15

n 0, 1 oder 2

20

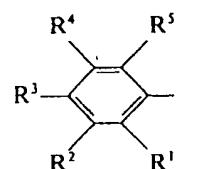
bedeuten.

2. Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamide gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in der allgemeinen Formel I

25

Ar eine Phenylgruppe der allgemeinen Formel

30



R¹ und R⁵, die gleich oder verschieden sind, ein Halogenatom, einen Methylrest, einen Trifluormethylrest, eine Nitrogruppe, einen Methoxyrest oder eine Methoxycarbonylgruppe, R², R³ und R⁴, die gleich oder verschieden sind, ein Wasserstoffatom, ein Halogenatom, einen Trifluormethylrest oder einen C₁—C₄-Alkylrest,

35

R⁶ ein Wasserstoffatom, ein einwertiges Metalläquivalent oder eine C₁—C₄-Acylgruppe und

R⁷ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₄-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest oder einen C₁—C₄-Alkoxyrest bedeuten.

40

3. Verfahren zur Herstellung von Pyrido[3,2-e][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-sulfonsäureamiden der allgemeinen Formel I, dadurch gekennzeichnet, daß man

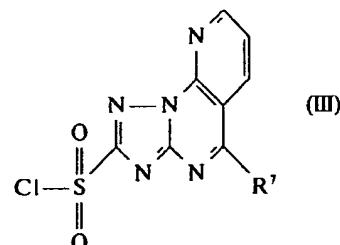
A) Amine der allgemeinen Formel II



45

in der Ar die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat und R¹¹ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₆-Alkylrest, einen C₂—C₆-Alkenylrest oder einen C₂—C₆-Alkinylrest bedeutet, mit einem Sulfonsäurechlorid der allgemeinen Formel III

50



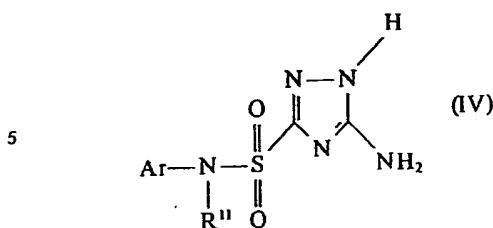
55

in der R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebene Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

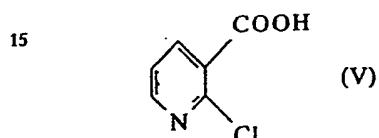
60

B) eine Verbindung der allgemeinen Formel IV

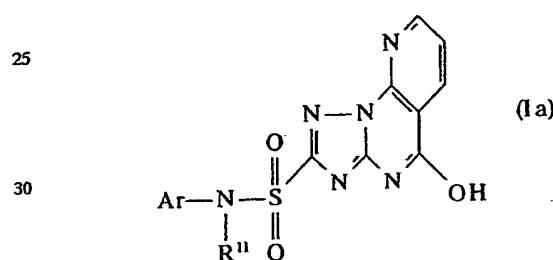
65



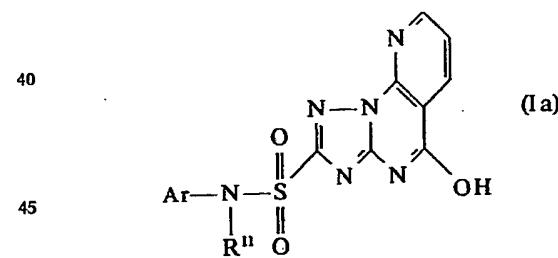
10 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit 2-Chlorinicotinsäure der Formel V



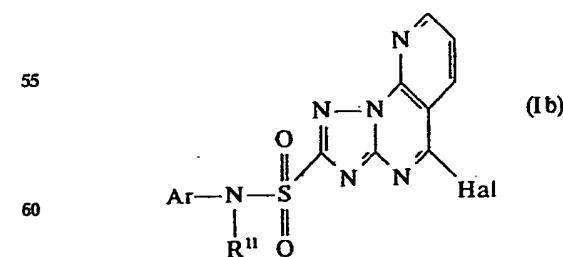
20 in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und weiterer Katalysatoren zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ia



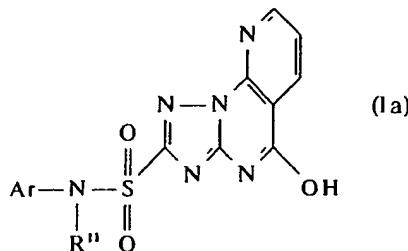
35 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt,
C) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia



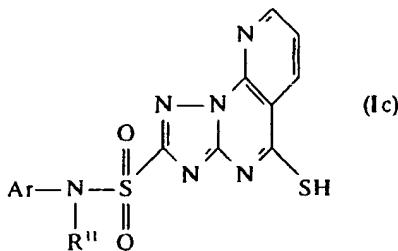
50 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einem Halogenierungsreagenz in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib



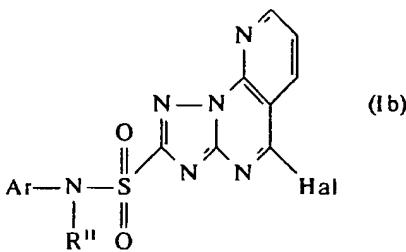
65 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, umgesetzt,
D) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ia



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit Lawesson's Reaganz oder Phosphorpentasulfid in einem geeigneten Lösungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ic



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt, E) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ib



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und Hal ein Halogenatom bedeutet, mit einem Alkohol der allgemeinen Formel VI



in der R¹² einen C₁—C₆-Alkylrest oder einen Halogen-C₁—C₆-alkylrest bedeutet, mit einer Schwefel enthaltenden Verbindung der allgemeinen Formel VII



in der R⁸ und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, oder einem Amin der allgemeinen Formel VIII



in der R⁹ und R¹⁰ die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, in einem geeigneten Lösungsmittel und in Gegenwart eines Säureakzeptors oder Katalysators zu Verbindungen der allgemeinen Formel Id

60

10

15

20

25

30

35

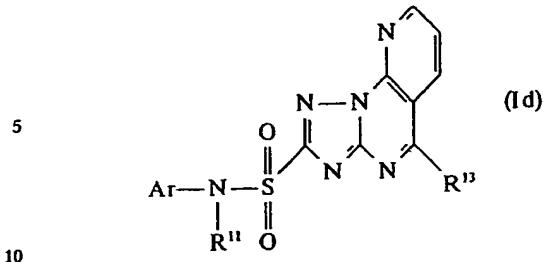
40

45

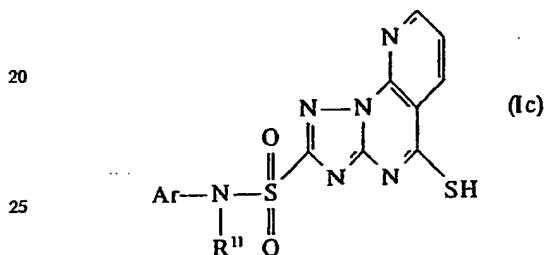
50

55

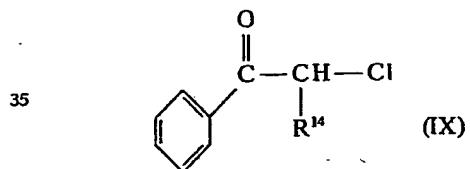
65



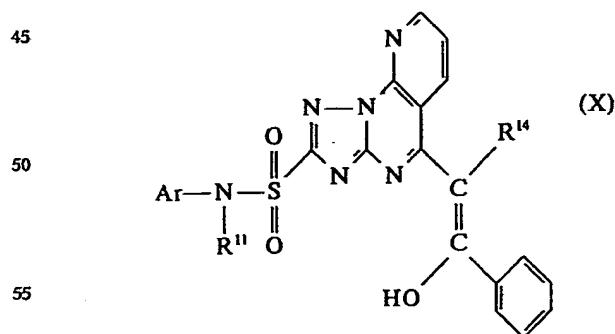
in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben und R¹³ einen C₁—C₆-Alkoxyrest, einen Halogen-C₁—C₆-alkoxyrest, eine Schwefel enthaltende Gruppe R⁸—S(O)ₙ— oder eine Aminogruppe R⁹R¹⁰N— bedeutet, wobei R⁸, R⁹, R¹⁰ und n die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt,
15 F) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ic



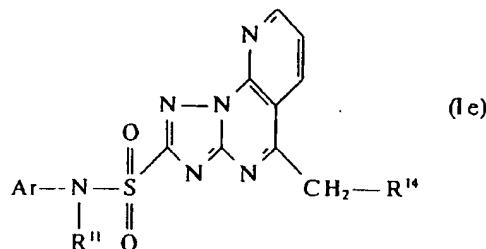
in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II angegebenen Bedeutungen haben, mit einer
30 Verbindung der allgemeinen Formel IX



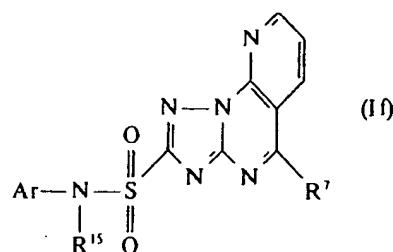
40 in der R¹⁴ ein Wasserstoffatom, einen C₁—C₅-Alkylrest, einen C₂—C₅-Alkenylrest oder einen C₂—C₅-Alkinylrest bedeutet, in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls eines Katalysators zunächst zu Verbindungen der allgemeinen Formel X.



60 in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II und R¹⁴ die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, und anschließend durch Erhitzen in einem geeigneten Lösungsmittel in Gegenwart einer Base in einer Retro-Aldol-Reaktion zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ie



in der Ar und R¹¹ die unter der allgemeinen Formel II und R¹⁴ die unter der allgemeinen Formel IX angegebenen Bedeutungen haben, umgesetzt,
G) eine Verbindung der allgemeinen Formel If



in der Ar und R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R¹⁵ ein Wasserstoffatom oder ein einwertiges Metalläquivalent bedeutet, mit Verbindungen der allgemeinen Formel XII

R⁸-Hal (XII)

30

oder der allgemeinen Formel XIII

R⁸-CO-Hal (XIII)

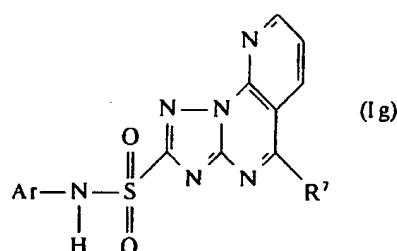
35

in denen R⁸ die unter der allgemeinen Formel I genannte Bedeutung hat, aber nicht für ein Wasserstoffatom steht, und Hal Chlor oder Brom bedeutet, oder der allgemeinen Formel XIV

R⁸-CO-O-CO-R⁸ (XIV)

40

in der R⁸ die oben genannte Bedeutung hat, in einem geeigneten Lösungsmittel umgesetzt,
H) eine Verbindung der allgemeinen Formel Ig



in der Ar und R⁷ die unter der allgemeinen Formel I angegebenen Bedeutungen haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel XV

M-Y (XV)

55

in der M ein einwertiges Metalläquivalent und Y ein Wasserstoffatom, eine Hydroxy-, Niederalkyl-, Niederalkoxy- oder Aminogruppe bedeutet, in einem Lösungsmittel umgesetzt.

4. Mittel mit herbizider, pflanzenwachstumsregulierender und fungizider Wirkung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung gemäß den Ansprüchen 1 und 2.

5. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Bekämpfung monokotyler und dikotyler Unkrautarten in landwirtschaftlichen Hauptkulturen.

6. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Wachstumsbeeinflussung von Kulturpflanzen.

7. Verwendung von Mitteln gemäß dem Anspruch 4 zur Bekämpfung eines Pilzbefalles in landwirtschaftli-

60

65

chen Kulturen.

8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln mit herbizider, wachstumsregulierender und fungizider Wirkung, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel I gemäß den Ansprüchen 1 und 2 mit Träger- und/oder Hilfsstoffen vermischt.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65